

**EUROPÄISCHE PATENTSCHRIFT**

**Veröffentlichungstag der Patentschrift:**  
08.04.88

**Anmeldenummer:** 84110072.0

**Anmeldetag:** 23.08.84

**Int. Cl.:** C 07 D 209/76, C 07 C 125/06,  
C 08 B 3/00, C 07 K 17/06,  
C 12 N 11/06

**N-Chlorcarbonyloxy-5-norbornen-2,3-dicarboximid, Verfahren zu seiner Herstellung und seine Verwendung.**

**Priorität:** 28.08.83 DD 254196  
28.08.83 DD 254197  
28.08.83 DD 254198  
28.10.83 DD 256056  
28.10.83 DD 256057

**Veröffentlichungstag der Anmeldung:**  
13.03.85 Patentblatt 85/11

**Bekanntmachung des Hinweises auf die Patenterteilung:**  
08.04.88 Patentblatt 88/14

**Benannte Vertragsstaaten:**  
AT BE CH DE FR GB IT LI NL SE

**Entgegenhaltungen:**  
DE-A-3 131 250

CANADIAN JOURNAL OF CHEMISTRY, Band 60,  
Nr. 4, 15. April 1982, A. PAQUET "Introduction of  
9-fluorenylmethoxycarbonyl, and benzyloxycarbonyl  
amine protecting groups into O-unprotected  
hydroxyamino acids using succinimidyl  
carbonates", Seiten 976-980  
BIOTECHNOLOGY AND BIOENGINEERING, Band  
24, 1982, JOHN WILEY & SONS, INC., J. DROBNIK  
et al. "The Activation of Hydroxy Groups of  
Carriers with 4-Nitrophenyl and  
N-Hydroxysuccinimidyl Chloroformates", Seiten  
427-432

**Patentinhaber:** Akademie der Wissenschaften der  
DDR, Otto-Nuschke-Strasse 22/23, DDR-1088  
Berlin (DD)

**Erfinder:** Henklein, Peter, Dr. Dipl.-Chem.,  
Schulze-Boyens-Strasse 25, DDR-1130 Berlin (DD)  
Erfinder: Becker, Manfred, Dr. Dipl.-Biol.,  
Mendelstrasse 52, DDR-1100 Berlin (DD)  
Erfinder: Büttner, Werner, Dr. Dipl.-Chem.,  
Treileborger Strasse 41, DDR-1100 Berlin (DD)  
Erfinder: Loth, Fritz, Dr. Dipl.-Chem., Ernst-  
Thälmann-Strasse 211, DDR-1530 Teltow (DD)  
Erfinder: Dautzenberg, Horst, Dr. Dipl.-Chem.,  
Moldaustasse 2 b, DDR-1530 Teltow (DD)  
Erfinder: Fomer, Klaus, Dr. Dipl.-Chem.,  
Florastrasse 34, DDR-1100 Berlin (DD)  
Erfinder: Dölling, Rudolf, Dr. Dipl.-Chem.,  
Lieselotte-Hermann-Strasse 7, DDR-1055 Berlin  
(DD)  
Erfinder: Graud, Karl-Heinz, Dipl.-Chem., Clara-  
Zetkin-Strasse 22, DDR-4300 Quedlinburg (DD)  
Erfinder: Halatsch, Wolf-Rainer, Dr. Dipl.-Chem.,  
Moskauer Strasse 34/35, DDR-1405 Glienicke (DD)  
Erfinder: Rupprich, Christian, Dipl.-Ing.,  
Langhoffstrasse 26, DDR-1145 Berlin (DD)

**Vertreter:** Patentanwälte Beetz sen. - Beetz jun.  
Timppe - Siegfried - Schmitt-Fursten,  
Steinsdorfstrasse 10, D-8000 München 22 (DE)

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents im Europäischen Patentblatt kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99(1) Europäisches Patentübereinkommen).

Anzeige der Ergebnisse aus WPINDEX Datenbank  
ANSWER 1 © 2002 DERWENT INFORMATION LTD

Title

New N-chlorocarbonyl oxy-5-norbornene-2,3-di carboximide - useful for prodn. of protected amino acids, activated c

Derwent Class

A96 B02

Inventor Name

BECKER, M; BUTTNER, W; DOLLING, R; DUTZENBER, H; FORNER, K; GRAUL, K H; HENKLEIN, P; LOTH,

Patent Assignee

(DEAK) AKAD WISSENSCHAFTEN DDR

Patent Information

EP 134041 A 19850313 (198511)\* DE 37p

<--

R: AT BE CH DE FR GB IT LI NL SE

DD 217215 A 19850109 (198519)

JP 60072862 A 19850424 (198523)

DD 218886 A 19850220 (198525)

DD 219481 A 19850306 (198527)

DD 219490 A 19850306 (198527)

DD 220969 A 19850410 (198532)

HU 38615 T 19860630 (198633)

HU 40139 T 19861128 (198701)

HU 40410 T 19861228 (198704)

DD 219481 B 19870617 (198744)

US 4714768 A 19871222 (198801)  
EP 134041 B 19880406 (198814) DE  
R: AT BE CH DE FR GB IT LI NL SE  
DE 3470309 G 19880511 (198820)  
DD 220969 B 19910117 (199124)  
JP 06122672 A 19940506 (199423) 14p C07D209-76

#### Application Details

EP 134041 A EP 1984-110072 19840823; JP 60072862 A JP 1984-173463 19840822; US 4714768 A US 1984  
Priority Application Information

DD 1983-254190 19830825; DD 1983-254196 19830825; DD 1983-254197  
19830825; DD 1983-254198 19830825; DD 1983-256056 19831028; DD  
1983-256057 19831028

#### International Patent Classification

ICM C07D209-76

ICS C07C125-06; C07D125-06; C07K001-04; C07K001-06; C07K017-06; C08B003-00; C08B015-06; C08F008

#### Abstract

EP 134041 A UPAB: 19930925

(A) N-Chlorocarbonyloxy-5-norbornene-2,3-dicarboximide of formula (I) is new:

(B) Prod'n. of protected amino acids or peptides of formula  $R_2NHCOOR$   $R_2NHCOOR_1$  (II), activated carriers of formula (III) and (IV), and carrier-ligand conjugates of formula  $LCOOQ$  (V) and  $L-CO-NR_4-Q$  (VI), is effected by: (a) reacting (I) with an alcohol of formula  $R_1OH$  and reacting the resulting asymmetric carbonate (VIII) with an amino acid or peptide  $R_2NH_2$  to form (II): In the formulae  $R_1 = t\text{-Bu}$ , 1-adamantyl, 2-diphenylpropyl (sic), 9-methylfluorenyl, methylsulphonylethyl, benzyl or another gp. normally used in peptide chem.;  $R_2 =$  an amino acid or peptide residue;

(b) reacting (I) with an OH-contg. polymer of formula  $QOH$  (X) and reacting the resulting activated carrier (IV) with a nucleophilic ligand  $LH$  to form a conjugate (V):  $Q =$  polymer residue;  $L = SR_3$ ,  $NHR_3$  or  $NR_5R_6$ ;  $R_3 = H$ , opt. subst'd. alkyl, opt. subst'd. aryl or an amino acid, peptide or protein residue;  $R_5$  and  $R_6 = H$  or opt. subst'd. alkyl or aryl.

(c) reacting (I) with an insoluble amino-contg. polymer of formula  $Q-NHR_4$  (XI) and reacting the resulting activated carrier (IV) with  $LH$  to form a conjugate (VI):  $R_4 = H$  or opt. subst'd. alkyl or aryl.

USE/ADVANTAGE - (III)-(VI) are useful in solid-phase peptide synthesis and for immobilising enzymes, assay reagents, etc. (I) is an easily prepd., stable cpd. (III) and (IV) have good hydrolytic stability in alkaline media, allowing coupling with ligands to be effected at high pH.  
0/0

#### Equivalent Abstract

EP 134041BUPAB: 19930925

Chlorocarbonyloxy-5-norbornene-2,3-dicarboximide of the formula (I).

US 4714768AUPAB: 19930925

A novel cpd. is N-(chlorocarbonyloxy)-5-norbornene-2,3-dicarboxamide (I). Prepn. of (I) can be carried out by the r  
USE/ADVANTAGE - (I) is an intermediate prod. for the mfr. of non-symmetrical carbonates and activated polymeric  
Accession Number

1985-063546 [11] WPINDEX

Document Number, CPI

C1985-027676

[Go to top of page] [Go to top of page] [Go to top of page]